

This Page Is Inserted by IFW Operations  
and is not a part of the Official Record

## **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning documents *will not* correct images,  
please do not report the images to the  
Image Problem Mailbox.**

⑨ 日本国特許庁(JP) ⑩ 特許出願公開  
⑪ 公開特許公報(A) 昭63-258467

⑫ Int. Cl.<sup>4</sup> 識別記号 庁内整理番号 ⑬ 公開 昭和63年(1988)10月25日  
C 07 D 251/20 7624-4C  
A 01 N 43/66 7215-4H  
C 07 D 251/34 J-7624-4C 審査請求 未請求 発明の数 2 (全5頁)

⑭ 発明の名称 2-フェノキシトリアジン誘導体及び除草剤

⑮ 特 願 昭62-91781

⑯ 出 願 昭62(1987)4月14日

⑰ 発 明 者 和 田 信 英 静岡県磐田郡福田町小島132番地  
⑱ 発 明 者 斎 藤 芳 宏 神奈川県横浜市緑区長津田1丁目16番1号  
⑲ 発 明 者 草 野 章 次 静岡県浜松市布橋1丁目17番12号  
⑳ 発 明 者 豊 川 泰 文 静岡県小笠郡菊川町加茂1809番地  
㉑ 発 明 者 宮 沢 武 重 静岡県小笠郡菊川町加茂1809番地  
㉒ 出 願 人 クミアイ化学工業株式 東京都台東区池之端1丁目4番26号  
会社  
㉓ 出 願 人 イハラケミカル工業株式 東京都台東区池之端1丁目4番26号  
会社

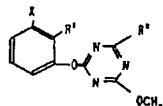
明 細 書

1. 発明の名称

2-フェノキシトリアジン誘導体及び除草剤

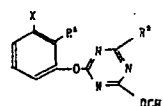
2. 特許請求の範囲

(1) 一般式



〔式中、Xは水素原子またはハロゲン原子を示し、R<sup>1</sup>はホルミル基または基CO・R<sup>1</sup>、(式中、R<sup>1</sup>は水素原子、低級アルキル基、またはベンジル基を示す。)を示し、R<sup>2</sup>はメチル基またはメトキシ基を示す。〕にて表される2-フェノキシトリアジン誘導体。

(2) 一般式



〔式中、Xは水素原子またはハロゲン原子を示し、

R<sup>1</sup>はホルミル基または基CO・R<sup>1</sup>、(式中、R<sup>1</sup>は水素原子、低級アルキル基、またはベンジル基を示す。)を示し、R<sup>2</sup>はメチル基またはメトキシ基を示す。〕にて表される2-フェノキシトリアジン誘導体を有効成分として含有する除草剤。

3. 発明の詳細な説明

(産業上の利用分野)

本発明は、新規な2-フェノキシトリアジン誘導体及びこれを有効成分として含有する水田、畑及び非農耕地等に適用できる除草剤に関するものである。

(従来の技術)

ケミカル アブストラクト (Chem. abst.) 第87巻68298にはベンゼン環上にカルボキシ基を有する2-フェノキシトリアジン誘導体が殺菌活性を有することが記載されている。また、特開昭54-55729号公報明細書には、ベンゼン環上にカルボキシ基を有する2-フェノキシトリアジン誘導体が除草活性を有することが記載されている。

( 発明が解決しようとする問題点 )

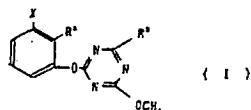
しかしながら、前述のケミカル アブストラクトには除草活性についてはなんら記載されていない。

また、前述公報明細書記載化合物の除草活性は不十分であるという欠点を有している。

本発明者らは、2-フェノキシトリアジン系化合物について除草活性の優れた化合物の開発を目的に鋭意研究した結果、トリアジン環及びベンゼン環上の特定の位置に置換基を導入した本発明化合物が優れた除草効果を示すことを見出し、本発明を完成した。

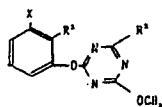
( 問題点を解決するための手段 )

本発明の2-フェノキシトリアジン誘導体は一般式



[ 式中、X は水素原子またはハロゲン原子を示し、R<sup>1</sup> はホルミル基または基 CO・R<sup>1</sup>、( 式中、R<sup>2</sup> は水素原子、低級アルキル基、またはベンジル基

3



第1表

化合物 番号	X	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	融点(℃) または 屈折率(n <sub>D</sub> <sup>20</sup> )
1	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	64~68
2	H	CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	53~54
3	H	CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -o	OCH <sub>3</sub>	59~60
4	H	CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -i	OCH <sub>3</sub>	54~55
5	H	CO <sub>2</sub> H	OCH <sub>3</sub>	148~152
6	F	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	107~111
7	Cl	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	1.5330
8	Cl	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	OCH <sub>3</sub>	117~118
9	Cl	CHO	OCH <sub>3</sub>	140~143
10	Cl	CO <sub>2</sub> H	OCH <sub>3</sub>	138~140
11	Cl	CHO	CH <sub>3</sub>	111~114
12	Cl	CO <sub>2</sub> H	CH <sub>3</sub>	147~151

5

を示す。)を示し、R<sup>1</sup>はメチル基またはメトキシ基を示す。)にて表される

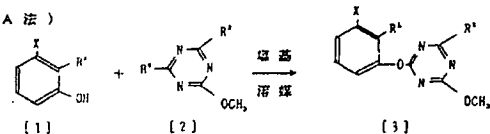
前記一般式( I )にて表わされる本発明化合物を第1表に例示する。

尚、化合物番号は以後の記載において参照される。

4

本発明化合物は下記の方法に従って製造することができるが、これらの方法に限定されるものではない。

( A 法 )



( 式中、R<sup>1</sup> はハロゲン原子を示し、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup> 及びX は前記と同じ意味を示す。 )

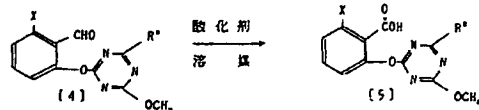
式[3]で示される本発明化合物は式[1]で示される化合物と式[2]で示されるトリアジン化合物とを塩基の存在下、好ましくは溶媒中で室温ないし溶媒の沸点の温度範囲で1~24時間反応させることにより製造することができる。無溶媒下で反応を行う場合は塩基として、無水炭酸カリウムのようなアルカリ金属の炭酸塩等を使用して120~160℃の温度範囲内で反応させることもできる。

ここに使用される溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム等のハロゲン化炭化

6

水素系溶媒、エタルエーテル、イソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル系溶媒、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン系溶媒、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル系溶媒、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒及びアセトニトリル、水等が挙げられる。また塩基としては、金属ナトリウム、金属カリウム等のアルカリ金属類、水素化ナトリウム、水素化カリウム、水素化カルシウム等の水素化アルカリ金属及び水素化アルカリ土類金属類、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸塩類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化金属類が挙げられる。

(B法)



(式中、X及びR<sup>2</sup>は前記と同じ意味を示す。)

## 7

## 実施例1

2-(4,6-ジメトキシ-S-トリアジン-2-イル)オキシ安息香酸メチルの合成(化合物1)

2-クロロ-4,6-ジメトキシ-S-トリアジン(3.2g)及び炭酸カリウム(3.2g)をジメチルホルムアミド(20ml)に懸濁後、サリチル酸メチル(3.5g)をジメチルホルムアミド(10ml)に溶解した溶液を室温で滴下した。70~80℃で3時間加熱攪拌して反応終了とし、冷却後、反応液を水にかけ、析出した結晶を濾過した。結晶はメタノールで再結晶し、無記化合物を白色結晶(5.4g)として得た。

(融点64~68℃)

## 実施例2

2-クロロ-6-(4,6-ジメトキシ-S-トリアジン-2-イル)オキシ安息香酸の合成

(化合物10)

2-クロロ-6-(4,6-ジメトキシ-S-トリアジン-2-イル)オキシベンズアルデヒド

本発明化合物の内、式[5]で示される化合物は、式[4]で示される化合物を酸化剤の存在下、極性溶媒、水、または極性溶媒と水との混合溶媒中、氷冷下ないし溶媒の沸点の温度範囲で0.5~24時間反応させることにより製造することができる。

ここに使用される溶媒としては、例えばアセトン、n-ブチルアルコール、酢酸、ヒリジン、ジオキサン等の極性溶媒、水及びアセトン、n-ブチルアルコール、酢酸、ヒリジン、またはジオキサン等の水と極性溶媒との混合溶媒が挙げられる。また、酸化剤としては、酸素、過酸化水素水、クロム酸、酸化剤及び過マンガン酸カリウム、過マンガン酸バリウム、過マンガン酸カルシウム、過マンガン酸マグネシウム等の過マンガン酸塩等を挙げることができる。

次に実施例を挙げて説明する。

## 8

(4.0g)をアセトン(30ml)に溶解後、当量量の過マンガン酸カリウム水溶液(20ml)を少量ずつ滴下した。室温にて4時間攪拌後、析出した沈澱物を濾過した。濾液を5%塩酸水溶液で酸性とし、エーテルで塩析抽出した。抽出液は水洗、乾燥後溶剤を減圧下に留去し、残液をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、無記化合物(1.6g)を得た。

(融点138~140℃)

本発明の除草剤は、本発明化合物である2-フェノキシトリアジン誘導体を含んでなる。

本発明化合物を除草剤として使用する場合は、化合物のみ、またはこれに農薬の製剤化に際し一般的に用いられる、担体、界面活性剤、分散剤、補助剤等を配合して、水和剤、粒剤、乳剤または粉剤等の各種形態に製剤して使用することができる。

製剤化に際して用いられる担体としては、例えば、ジークライト、タルク、ベントナイト、クレイ、カオリン、珪藻土、ホワイトカーボン、パー

ミキュライト、消石灰、珪砂、硫安、尿素等の固体担体、イソプロピルアルコール、キシレン、シクロヘキサノン、メチルナフタレン等の液体担体等が挙げられる。界面活性剤及び分散剤としては、例えば、アルコール硫酸エステル塩、アルキルアリールスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、ポリオキシエチレングリコールエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンソルビタンモノアルキレート等が挙げられる。補助剤としては、例えば、カルボキシメチルセルロース、ポリエチレングリコール、アラビアゴム等が挙げられる。使用に際しては、適当な濃度に希釈して散布するかまたは直接施用する。

また、本発明の除草剤は他の除草剤と混合して使用する事もできる。

本発明除草剤は、水田において、雑草の発芽前または発芽後に湛水・土壌処理または茎葉処理することにより、水田に発生する各種の雑草を防除することができる。また、畑地においても、雑草の発芽前または発芽後に土壌処理、または茎葉処理

することにより、畑地に発生する各種の雑草を防除することができる。

本発明除草剤は、有効成分で10アール当たり0.1g～1kg施用する。また植物茎葉に散布する場合は1ppm～10000ppmに希釈して施用する。

次に、本発明除草剤の実施例を挙げるが、本発明はこの範囲に限定されるものではない。

尚、実施例中に記載の％は重量百分率を示す。

#### 実施例3（水和剤）

化合物（1）10％、エマルゲンB10（花王石油株式会社登録商標）0.5％、デモールN（花王石油株式会社登録商標）0.5％、クニライト（クニミネ工業株式会社登録商標）20120％、ジークライト（ジークライト株式会社登録商標）CA69％を均一に混合粉砕して水和剤とした。

#### 実施例4（乳剤）

化合物（3）30％、シクロヘキサノン20％、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル11％、アルキルベンゼンスルホン酸カルシウム4％、及びメチルナフタリン35％を均一に溶解して乳剤とした。

#### 実施例5（粒剤）

化合物（6）5％、ラウリルアルコール硫酸エステルナトリウム塩2％、リグニンスルホン酸ナトリウム5％、カルボキシメチルセルロース2％、及びクレール86％を均一に混合粉砕する。この混合物100重量部に水20重量部を加えて配合し、押出式造粒機を用いて14～32メッシュの粒状に加工したのち、乾燥して粒剤とした。

#### 実施例6（粉剤）

化合物（7）2％、珪砂5％、及びクレール3％を均一に混合粉砕して粉剤とした。

#### （発明の効果）

本発明の化合物及び除草剤は、水田に発生するタイヌビエ、タマガヤツリ、コナギ、ホタルイ、ヘラオモダカ等の一年生雑草及びミズガヤツリ、ウリカワ、クログワイ等の多年生雑草を有効に防除することができる。また、畑地に発生するヒエ、メヒシバ、オヒシバ、エノコログサ、スズメノテッポウ、スズメノカタビラ、カラスミギ、イタリアンライグラス、オオイタタデ、アオビユ、シロザ、アカザ、イチビ、アメリカキンゴジカ、エビスグサ、ハコベ、アサガオ、オナモミ、コゴメガヤツリ、メリケンクキビ、イチグサ、ウマノチャヒキ、ソバカズラ、ノハラガラシ、アメリカセンダングサ等の一年生雑草及びハマスゲ、ジョンソングラス、ギョウギシバ、シバムギ等の多年生雑草をも有効に防除することができる。一方、作物に対する安全性も高い。更に、本発明化合物は、前述の公開公報記載の公知化合物と比較しても、除草効果が優れているという特徴を有するものである。

次に、本発明除草剤の奏する効果を試験例を挙げて説明する。

#### 試験例1(莖葉処理)

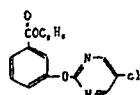
土壌を充填した100cmポットにヒエ、メヒシバ、オオイタダデ、アオビユ、シロザ及びコゴメガヤツリの各種子を播種し、0.5~1cmに覆土した。ポットは20~25℃のガラス室内で2週間育成後に実施例3に準じて調製した水和剤を有効成分で10アール当り400gとなるよう10アール当り100Lの水で希釈し、莖葉表面に散布した。調査は薬剤処理後14日目に第2表の基準に従い行った。結果を第3表に指数で示した。

第2表

指数	除 草 効 果
0	除草効果なし
1	0%を超え30%未満の除草効果
2	30%以上、50%未満の除草効果
3	50%以上、70%未満の除草効果
4	70%以上、90%未満の除草効果
5	90%以上の除草効果

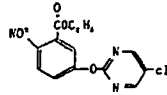
2. 比較化合物A、B及びCは下記の化合物を表す。(他の表も同じである)

A



(特開昭-54-55729号公報記載)

B



(特開昭-54-55729号公報記載)

#### 試験例2(土壌処理)

土壌を充填した100cmポットにヒエ、メヒシバ、オオイタダデ、アオビユ、シロザ及びコゴメガヤツリの各種子を播種し、0.5~1cmに覆土した。播種翌日に実施例3に準じて調製した水和剤を有効成分で10アール当り400gとなるよう10アール当り100Lの水で希釈し、土壌表面に散布した。薬剤処理20日目に第2表の基準に従い行った調査結果を第4表に指数で示した。

第3表

化合物番号	除 草 効 果					
	Ech	Dig	Pol	Aaa	Che	Cyl
1	5	5	5	5	5	5
2	5	5	5	5	5	5
3	5	5	5	5	5	5
5	5	5	5	5	5	5
6	4	4	3	4	5	4
9	4	4	5	5	4	5
10	5	5	5	5	5	5
12	5	5	5	5	5	5
比較化合物A	0	1	2	2	0	5
比較化合物B	1	1	2	1	1	5

(注)

1. 試験植物の略記号は下記の植物を表す。(他の表も同様である)

Ech:ヒエ (Echinochloa crus-galli)  
 Dig:メヒシバ (Digitaria adscendens)  
 Pol:オオイタダデ (Polygonum nodosum)  
 Aaa:アオビユ (Amaranthus retroflexus)  
 Che:シロザ (Chenopodium album)  
 Cyl:コゴメガヤツリ (Cyperus iria)

第4表

化合物番号	除 草 効 果					
	Ech	Dig	Pol	Aaa	Che	Cyl
1	5	5	5	5	5	5
2	4	4	3	4	4	5
3	5	5	4	4	5	5
5	5	5	3	5	5	5
6	4	5	5	5	3	5
8	0	3	5	5	5	0
10	5	5	5	5	5	5
12	1	2	5	5	5	2
比較化合物A	0	0	0	0	0	5
比較化合物B	0	0	0	0	2	5

特許出願人  
 クミアイ化学工業株式会社  
 ほか 1名